

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2000-226372

(P2000-226372A)

(13)公開日 平成12年8月15日 (2000.8.15)

(51)Int.Cl.
C 07 D 213/82
A 01 N 43/40

識別記号
101

F I
C 07 D 213/82
A 01 N 43/40

ラーマコード(参考)
4 C 0 5 5
1 0 1 F 4 H 0 1 1
1 0 1 C
1 0 1 B
1 0 1 E

審査請求 未請求 請求項の数4 OL (全47頁) 最終頁に続く

(21)出願番号

特願平11-24317

(22)出願日

平成11年2月1日 (1999.2.1)

(71)出願人 000004307

日本苔達株式会社
東京都千代田区大手町2丁目2番1号

(72)発明者 宮原 治

神奈川県小田原市高田345 日本苔達株式
会社小田原研究所内

(72)発明者 小倉 美佳

神奈川県小田原市高田345 日本苔達株式
会社小田原研究所内

(74)代理人 100108419

弁理士 大石 治仁

最終頁に続く

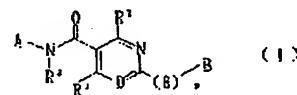
(54)【発明の名稱】 アミド化合物、その製造方法及び農園芸用殺虫剤

(57)【要約】

【課題】工業的に有利に合成でき、効果が確実で安全に使用できる有効生物防除剤、特に農園芸用殺虫・殺ダニ剤となりうる新規なアミド化合物及びその製造方法を提供する。

【解決手段】一般式(1)

【化1】



ルキル基、C₁～アルコキシ基等を表し、Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH₂、CH、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。但し、公知化合物を除く。)で表されるアミド化合物、その製造方法及び有効生物防除剤。

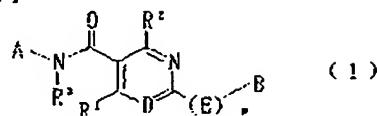
【式中、Aは、置換基Xを有していてもよい(フェニル基又はナフチル基)を表し、Bは、置換基Yを有していてもよい(フェニル基を表し、X及びYは、ニトロ基、ハロゲン原子、C₁～アルキル基、C₁～ハロアルキル基、C₁～アルコキシ基、C₁～ハロアルコキシ基等を表し、R¹及びR²は、水素原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C₁～アルキル基、C₁～アルキコキシ基、C₁～ハロアルキル基、C₁～ハロアルコキシ基等を表し、R³は、水素原子、C₁～ア

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(1)

【化1】



【式中、Aは、置換基Xを有していてもよいフェニル基又は置換基Xを有していてもよいナフチル基を表し、Bは、置換基Yを有していてもよいフェニル基又は置換基Yを有していてもよいナフチル基を表す。また、前記A及びBは同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。X及びYは、それぞれ独立して、シアノ基、ニトロ基、ハログン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、アルキルスルホニルオキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、(C₁₋₆アルキル基で置換されていてもよい)カルバモイル基、C₁₋₆アルキルチオ基又はC₁₋₆アルキルスルホニル基を表し、R¹及びR²は、それぞれ独立して、水素原子、ヒドロキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハログン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基又は置換基を有していてもよいフェニルオキシ基を表し、R³は、水素原子、ヒドロキシ基、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基又は置換基を有していてもよいフェニル基を表し、Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH₂、CH₂CH₂又はCOを表し、pは、0又は1を表す。但し、Aが2、4-ジフルオロフェニル基であり、Bが4-1-ブチルフェニル基であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、R¹、R²の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である化合物、Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R¹が水素原子であり、R²がメチル基である化合物、Aが2、6-ジエチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R¹が1-ブロボキシ基であり、R²がメチル基である化合物、及びR¹及びR²が同時に水素原子である化合物を除く。】で表されるアミド化合物

【請求項2】 前記R¹又はR²のいずれか一方がC₁₋₆ハロアルキル基である、請求項1記載の一般式(1)で表されるアミド化合物。

【請求項3】 一般式(2)

【化2】

2

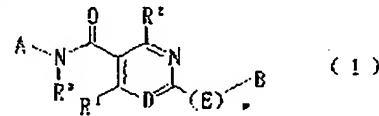
(2)

【式中、A、D、R¹、R²及びR³は前記と同じ意味を表し、Lは脱離基を表す。】で表される化合物と、一般式(3)

【化3】 M-(O)-B (3)

【式中、B及びpは前記と同じ意味を表し、Mは、金属又は有機金属基を表す。】で表される化合物とを反応させる工程を有する、一般式(1)

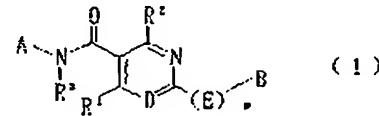
【化4】



【式中、A、B、D、R¹、R²、R³及びpは、前記と同じ意味を表す。】で表される化合物の製造方法。

【請求項4】 一般式(1)

【化5】



【式中、A、B、D、E、R¹、R²、R³及びpは、前記と同じ意味を表す。】で表される化合物の一種若しくは二種以上を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、新規なアミド化合物、その製造方法及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 農園芸作物の栽培に当り、従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されている。しかしながら、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に葉害や汚染を生じたり、或いは人畜魚類等に対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない完全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

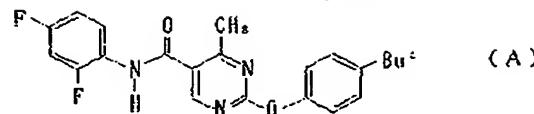
【0003】 本発明化合物に類似した化合物を開示したものとしては、次のものが知られている。

(1) E.P. 569,912号公報には、下記(A)に示される化合物が、農園芸用殺虫剤として有用である旨が記載されている。

[0004]

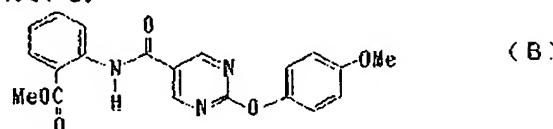
3

* * [化6]



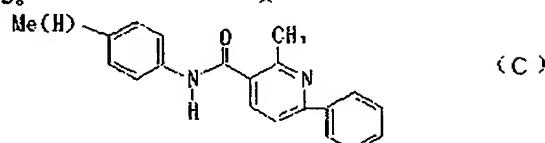
[0005] (2) WO95/25,723号公報には、下記(B)で示される化合物が農園芸用殺虫剤として有用である旨が記載されている。

※



[0007] (3) Zh. Obschh. Khim., 19(4) 359 (1984) には、下記(C)で示される化合物が記載されている。

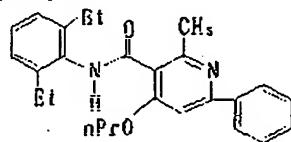
★



[0009] (4) また、特開昭63-17813号公報には、下記(D)で示される化合物が記載されている。

[0010]

[化9]



[0011] しかしながら、本発明化合物が、農作物害虫に対し殺虫活性を有することは知られていない。

[0012]

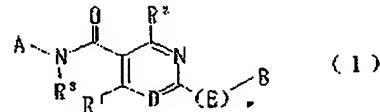
【発明が解決しようとする課題】 本発明は、工業的に有利に合成でき、効果が確実で安全に使用できる農園芸用殺虫剤となりうる新規なアミド化合物、及びその製造方法を提供することを目的とする。

[0013]

【課題を解決するための手段】 上記課題を解決すべく、本発明は、(i) 下記一般式(1)

[0014]

[化10]



30 [0015] (式中、Aは、置換基Xを有していてよいフェニル基又は置換基Xを有していてよいナフチル基を表し、Bは、置換基Yを有していてよいフェニル基又は置換基Yを有していてよいナフチル基を表し、X及びYは、それぞれ独立して、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基、置換基を有していてよいフェニル基、アルキルスルホニルオキシ基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、(C₁₋₆アルキル基で置換されていてよい)カルバモイル基、C₁₋₆アルキルチオ基又はC₁₋₆アルキルスルホニル基を表す。また、前記A及びBは同一又は組合なる複数の置換基を有していてよい。

40 [0016] R¹及びR²は、それぞれ独立して、水素原子、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基、置換基を有していてよいフェニル基、置換基を有していてよいフェニルオキシ基又はヒドロキシ基を表し、R³は、水素原子、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、C₁₋₆

アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆シクロアルキル基又は置換基を有していてもよいフェニル基を表し、Dは、N又はCHを表し、Eは、O、CH₂、CH、C₁₋₆H、又はCOを表し、pは、0又は1を表す。)で表されるアミド化合物を提供する。

【0017】但し、前記一般式(1)で表される化合物のうち、以下の(a)、(b)、(c)及び(d)の化合物は除外かれている。

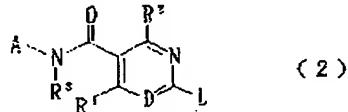
(a) Aが2、4-ジフルオロフェニル基であり、Bが4-メチルフェニル基であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、R¹、R²の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である化合物、(b) Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R¹が水素原子で、R²がメチル基である化合物、(c) Aが2、6-ジエチルフェニル基であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R¹がn-ブロボキシ基で、R²がメチル基である化合物、及び、(d) R¹及びR²が同時に水素原子である化合物。

【0018】また、本発明においては、前記一般式(1)で表される化合物のうち、R¹又はR²のいずれか一方がC₁₋₆ハロアルキル基である化合物が、特に好ましい。

【0019】(ii) また、本発明は、一般式(2)

【0020】

【化11】



【0021】(式中、A、D、R¹、R²及びR³は前記と同じ意味を表し、Lは脱離基を表す)で表される化合物と、一般式(3)

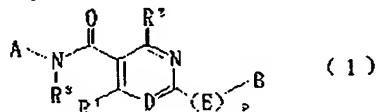
【0022】

【化12】M-(O)-B (3)

(式中、B及びpは前記と同じ意味を表し、Mは、金属又は有機金属基を表す。)で表される化合物とを反応させる工程を有する、一般式(1)

【0023】

【化13】

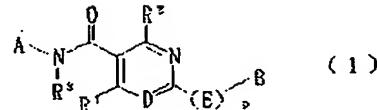


【0024】(式中、A、B、D、R¹、R²及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の製造方法を提供する。

【0025】(iii) さらに本発明は、一般式(1)

【0026】

【化14】



【0027】(式中、A、B、D、E、R¹、R²、R³及びpは、前記と同じ意味を表す。)で表される化合物の一塩若しくは二塩以上を有効成分として含有することを特徴とする、農園芸用殺虫剤を提供する。

【0028】本発明化合物は、特に農園芸用作物の有害害虫に対して優れた殺虫活性を有し、本発明化合物を有効成分とする組成物は、有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤として有用である。

【0029】

【発明の実施の形態】以下、本発明を発明の実施の形態により詳細に説明する。本発明化合物は、前記一般式

20 (1) で表される化合物である。前記一般式(1)において、Aは、ベンゼン環の任意の位置に置換基Xを有していてもよいフェニル基、又はナフタレン環の任意の位置に置換基Xを有していてもよい、1-ナフチル、2-ナフチル基等のナフチル基を表す。また、Aは、同一又は相異なる複数の置換基Xを有していてもよい。

【0030】Bは、ベンゼン環の任意の位置に置換基Yを有していてもよいフェニル基、又はナフタレン環の任意の位置に置換基Yを有していてもよい、1-ナフチル、2-ナフチル基等のナフチル基を表す。また、B

30 は、同一又は相異なる複数の置換基Yを有していてもよい。

【0031】X及びYは、それぞれ独立して水素原子、シアノ基、ニトロ基、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、ベンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐のC₁₋₆アルキル基、クロロメチル、シクロロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチルウ、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエトキシ基等のC₁₋₆ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロベンチル、シクロヘキシル基等のC₃₋₆シクロアルキル基、

40 ペンタフルオロエチル基等のC₁₋₆ハロアルキル基、【0032】メトキシ、エトキシ、ブロボキシ、イソブロボキシ、ブトキシ、t-ブトキシ、sec-ブトキシ基等のC₁₋₆アルコキシ基、クロロメトキシ、シクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ基等のC₁₋₆ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロベンチル、シクロヘキシル基等のC₃₋₆シクロアルキル基、

【0033】ベンゼン環の任意の位置に置換基を有して50 いてもよいフェニル基、メチルスルホニルオキシ、エチ

ルスルホニルオキシ、プロビルスルホニルオキシ基、イソプロビルスルホニルオキシ、ブチルスルホニルオキシ基等のC₁₋₁₀。アルキルスルホニルオキシ基、アセチル、プロピオニル基等のC₁₋₁₀。アルキルカルボニル基、アセトキシ、プロピオニルオキシ基等のC₁₋₁₀。アルキルカルボニルオキシ基、(エチル、メチル、プロピル、イソプロピル、ブチル基等のC₁₋₁₀。アルキル基で置換されてもよい)カルバモイル基、メチルチオ、エチルチオ、プロビルチオ、イソプロビルチオ、ブチルチオ基等のC₁₋₁₀。アルキルチオ基、又は、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロビルスルホニル、イソプロビルスルホニル、ブチルスルホニル基等のC₁₋₁₀。アルキルスルホニル基を表す。

〔0034〕ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハロゲン原子、メチル、エチル基等のC_{1..}、アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ基等のC_{1..}、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

〔0035〕R¹ 及び R² は、それぞれ独立して水素原子、シアノ基、ヒドロキシ基、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、ベンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐のC₁~₆アルキル基、クロロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロエチル、トリフルオロエチル、ベンタフルオロエチル基等のC₁~₆ハロアルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシ、sec-ブトキシ基等のC₁~₆アルコキシ基、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ベンタフルオロエトキシ基等のC₁~₆ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロベンチル、シクロヘキシル基等のC₃~₆シクロアルキル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は、置換基を有していてもよいフェニルオキシ基を表す。

〔0036〕ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基又は置換基を有していてもよいフェニルオキシ基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハログン原子、メチル、エチル基等のC₁~C₄アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソブロボキシ基等のC₁~C₄アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基又はフェニルオキシ基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

〔0037〕この場合において、R¹ 及びR² のどちらか一方は、C₁₋₅ ハロアルキル基であるのが好ましく、

より好ましくは、R¹ 及びR² のどちらか一方は、C₁～ハロアルキル基であり、もう一方は、水素原子、ハロゲン原子、C₁～アルキル基、C₁～ハロアルキル基、C₁～アルコキシ基、C₁～ハロアルコキシ基、C₁～シクロアルキル基、置換基を有していてもよい。フェニル基、シアノ基、ニトロ基又はヒドロキシ基である。

〔0038〕R³は、水素原子、シアノ基、ヒドロキシ基、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、ベンチル、ヘキシル基等の直鎖若しくは分岐のC₁₋₆アルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシ、sec-ブトキシ基等のC₁₋₆アルコキシ基、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロエトキシ、トリフルオロエトキシ、ペニタフルオロエトキシ基等のC₁₋₆ハロアルコキシ基、シクロプロピル、シクロベンチル、シクロヘキシル基等のC₃₋₆シクロアルキル基、又は、置換基を有していてもよいフェニル基を表す。

29 【0039】ここで、前記置換基を有していてもよいフェニル基の置換基としては、フッ素、塩素、臭素等のハロゲン原子、メチル、エチル基等のC₁₋₃、アルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ基等のC₁₋₃、アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基等を挙げることができる。また、該フェニル基は、ベンゼン環の任意の位置に同一又は相異なる複数の置換基を有していてもよい。

[0040] Dは、N又はCHを衰し、Eは、O、CH₂、CH、CH₃又はCOを衰し、Fは、O又はIを衰す。

30. [0041] 前記一般式(1)で表される化合物のうち、Aが2,4-ジフルオロフェニル基(上位概念的には、2,4位にハロゲン原子を有するフェニル基)であり、Bが4-*t*-ブチルフェニル基(上位概念的には、4位にC₄基を有するフェニル基)であり、DがNであり、EがOであり、pが1であり、かつ、R¹、R²の一方が水素原子で、もう一方がメチル基である前記一般式(1)で表される化合物。

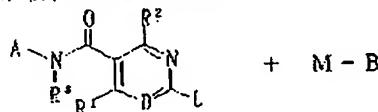
【0042】Aがフェニル基又は4-メチルフェニル基
(上位概念的には、フェニル基又は4位にC₁、アルキ
49 ル基を有するフェニル基)であり、Bがフェニル基であ
り、DがCH₂であり、pがりであり、かつ、R¹が水素
原子であり、R²がメチル基である化合物、

【043】Aが2, 6-ジエチルフェニル基(上位概念的には、2, 6位にC₂-アルキル基を有するフェニル基)であり、Bがフェニル基であり、DがCHであり、pが0であり、かつ、R²がn-ブロボキシ基であり、R¹がメチル基である化合物、及び、

〔044〕R¹ 及び R² が同時に水素原子である化合物は公知化合物である。従って、本発明においてはこれらの化合物は除かれている。

【0045】本発明化合物は以下の方法により製造することができる。

(製造法1) 前記一般式(1)において、Dがリの化合物(1-1)は、以下のようにして製造することができる*



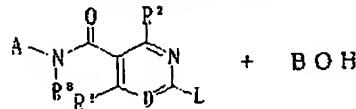
(2)

(3)

【0047】(式中、A、B、D、p、R¹、R²及びR³は前記と同じ意味を表し、しは、塩素、臭素、メシル基、トリル基等の脱離基を表し、Mは、ナトリウム、カリウム、リチウム等のアルカリ金属、マグネシウム、カルシウム等のアルカリ土類金属、Cu、Ni等の遷移金属、SnBu₃、B(OH)₃等の有機金属基、MgBr、MgI等を表す。)

【0048】この方法は、一般式(2)で表される化合物と一般式(3)で表される化合物とを、不活性溶媒中、触媒の存在下、反応温度-50°C~200°C、好ましくは0°C~150°Cで、1~96時間反応させることにより、一般式(1-1)で表される化合物を製造するものである。

【0049】この反応に用いることができる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチメ



(2)

(3)

【0053】(式中、A、B、D、R¹、R²及びR³は前記と同じ意味を表す。)

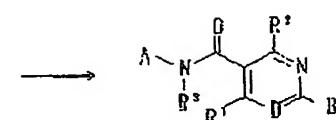
【0054】この方法は、一般式(2)で表される化合物と、一般式(9)で表される化合物とを、不活性溶媒中、塩基の存在下、反応温度-50°C~200°C、好ましくは0°C~150°Cで、1~96時間反応させることにより、一般式(1-2)で表される化合物を製造するものである。

【0055】この反応に用いることができる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等が挙げられ、好ましくは、THF、ジオキサン、アセトニトリルを例示することができる。

*る。

【0046】

【化15】



(1-1)

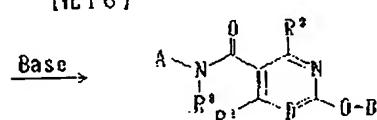
※ルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等が挙げられ、好ましくは、THF、ジオキサン、アセトニトリルを例示することができる。

【0050】また、この反応に用いることができる触媒としては、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド、ニッケル(II)アセチルアセトナート等が挙げられる。

【0051】(製造法2)前記一般式(1)において、Eが酸素原子の化合物(1-2)は、次のようにして製造することができる。

【0052】

【化16】



(1-2)

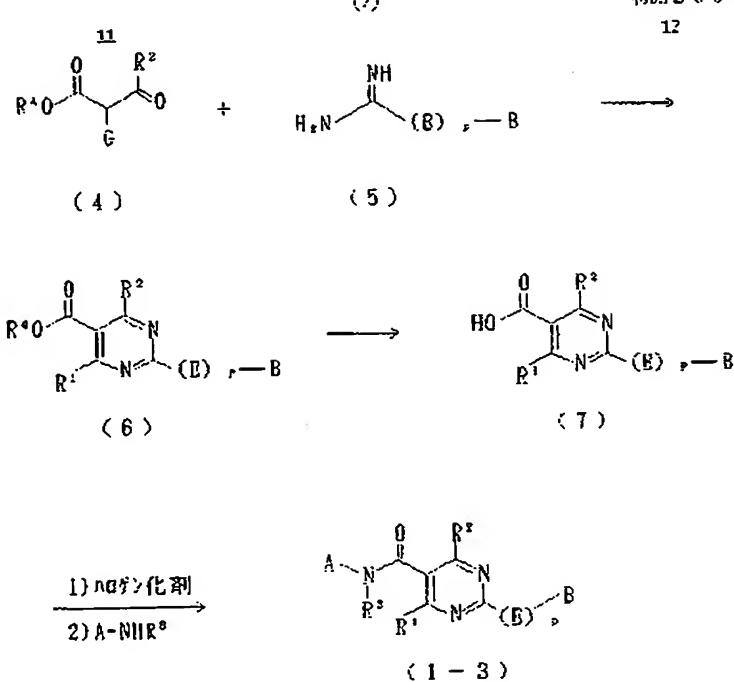
オキサン、アセトニトリルを例示することができる。

【0056】また、反応に用いることのできる塩基としては、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基や、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)等のアミン類、酸化銀(Ag₂O)及び炭酸銀等の金属塩等が挙げられる。

【0057】(製造法3)また、前記一般式(1)で表される化合物のうち、Dが酸素原子である化合物(1-3)は、次のような方法によっても製造することができる。

【0058】

【化17】



【0059】〔式中、A、B、E、R¹、R²、R³及びpは前記と同じ意味を表し（但し、R¹がハロゲン原子の場合を除く。）、R²は、低級アルキル基を表し、Gは、COR¹又は=C(R¹)OR²を表し、R³は、C₁～₆アルキル基を表す。〕

【0060】この方法は次の工程からなる。先ず、一般式(4)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物とを、不活性性媒中、塩基の存在下、反応温度-50℃～200℃、好ましくは0℃～150℃で、1～9時間反応させることにより、一般式(6)で表される中間体を得る。

【0061】この反応に用いることができる溶媒としては、メタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン（THF）、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）等が挙げられ、好ましくは、メタノールやエタノールを例示することができる。

【0062】また、反応に用いることのできる塩基としては、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基や、トリエチルアミン、DBU等のアミン類、酸化銀（Ag₂O）、炭酸銀等の金属類等が挙げられ、好ましくは、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等が挙げられる。

【0063】次いで、得られた中間体のエステルを通常

の加水分解反応により一般式(7)のカルボン酸とし、更に対応するカルボン酸ハライドとした後、A-NHR'で表される化合物と反応させることにより、一般式(1-3)で表される化合物を得ることができる。

【0064】一般式(7)のカルボン酸から対応するカルボン酸ハライドを合成する反応においては、塩化チオニル、塩化スルフルル等のハロゲン化剤を用いることができる。ハロゲン化剤は、カルボン酸1当量に対し、1当量から過剰量を使用することができる。

【0065】更に、前記一般式A-NHR'で表される化合物との反応においては、所望により炭酸カリウム、トリエチルアミン等の塩基を存在させてもよい。

【0066】これらの反応において用いることのできる溶媒としては、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭素類が挙げられる。

【0067】（製造法4）また、前記一般式(7)のカルボン酸と、前記一般式A-NHR'で表される化合物とを脱水縮合剤の存在下、直接に反応させることにより、一般式(1-3)で表される化合物を製造することができる。

【0068】この反応で用いることのできる脱水縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド（DCC）や、ジフェニルジスルフィドとn-ブチルホスフィン、アゾジカルボン酸ジエチルとトリフェニルホスフィン等が挙げられる。

【0069】また、この脱水縮合反応に用いられる溶媒

としては、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、塩化メチレン等のハロゲン化炭素類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)等が挙げられる。

【0070】いずれの反応を行った場合も、反応終了後は通常の後処理を行うことにより、目的物を得ることができる。本発明化合物の構造は、IR、NMR、Massスペクトルなどから決定することができる。

【0071】(殺虫・殺ダニ剤)このようにして得られる本発明化合物を実際に施用する際には、他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農業として使用する目的で一般の農業のとり得る形態、すなわち、粒剤、粉剤等の固型製剤、水和剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、プロアブル等の液体製剤の形態で使用することもできる。

【0072】固型製剤を目的とする場合には、添加剤及び担体として、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、焼灰石、石こう、タルク、ベントナイト、バイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物を用いることができる。

【0073】また、液体製剤を目的とする場合には、ケロシン、キシレン及びソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサン、DMF、DMSO、アルコール、アセトン、トリクロロエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として用いることができる。

【0074】さらに、これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要に応じ界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エスチル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エスチル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エスチル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エスチル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルdehyド結合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合物等が挙げられる。

【0075】これらの製剤中の有効成分(化合物(1))の含有量は、好ましくは0.01~9.0重量%、より好ましくは0.05~8.5重量%である。

【0076】このようにして得られる水和剤、乳剤、懸濁剤、プロアブル剤等の液体製剤は水で所定の濃度に希

祝して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤、粒剤等の固型製剤はそのまま植物に散布する方法で施用することができる。

【0077】(殺虫・殺ダニ剤)本発明化合物は、農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家庭害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のものが挙げられる。

【0078】鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシングイガ、ナシヒメシングイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルハ属、アグロティス属、イガ、コドリンガ、ワタアカミムシ等。半翅目害虫、例えば、モモアカアラムシ、ワタアラムシ、ニセダイコンアラムシ、ムギクビレアラムシ、ホソヘリカムシ、アオクサカムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシゲンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等。

【0079】鞘翅目害虫、例えば、キスジノミムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアブロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等。

【0080】双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチニクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等。絶翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等。膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等。直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ等。綿翅目害虫、例えば、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等。等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等。陰翅目害虫、例えば、ヒトノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、ダニ類、例えば、ナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレビバルバス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトグチマダニ等。植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

40

45

50

【0081】また、近年、コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫やハダニ類において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤又はビレスロイド剤抵抗性系統の害虫や殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。また、本発明化合物は葉害が少なく、魚害、混血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

【0082】また、本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。さらに、本発明化合物を塗料や繊維等に混入させることで、壁や浴槽、あるいは靴や衣服の防菌、防虫剤として使用することもできる。

【0083】本発明化合物を農園芸用殺菌剤、殺虫剤又は殺ダニ剤として用いる場合、単独でも十分な効力を発揮するが、各種の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤又は共力剤の1種類以上と混合して使用することもできる。

【0084】本発明化合物と混合して使用できる、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、植物成長調整剤としては、以下のようなものが挙げられる。

【0085】殺菌剤：キャブタジン、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロビネブ、ボリカーバメート、クロロタロニル、キントーゼン、キャブタホル、イブロジオン、プロサイミドン、ビンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メブロニル、フルトランニル、ベンシクロン、オキシカルボキシン、ホセチルアルミニウム、プロバモカーブ、トリアジメポン、トリアジメノール、プロビコナゾール、シクロブトラゾール、ビテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイブロコナゾーズ、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラジエート、トリデモルフ、フェンプロビモルフ、トリホリン、ブチオベート、ビリフェノックス、アニラジン、ボリオキシン、メタラキシリル、オキサジキシリル、フララキシリル、イソブロヂオラン、プロベナゾール、ビロールニトリル、プラストサイジンS、カスガマイシン、バリタマイシン、硫酸ジヒドロストレブトマイシン、ベノミル、カルベンタジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性堿化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ビナバクリル、レシチン、重質、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メバニビリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアシ

ナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ビロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロバモカルブ塩酸塩、オキソリニック酸、フェナモリル、シプロコナゾール、エポキシコナゾール、メトコナゾール、ヒドロキシソオキサゾール、イミノクタジン酢酸塩等。

【0086】殺虫・殺ダニ剤：

有機磷及びカーバメート系殺虫剤：フェンチオン、フェ

ニトロチオン、ダイアジノン、クロルビリホス、ES P、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、ラサン、トリクロルホン、チオメトン、ホスマット、ジクロルホス、アセフェート、EPBP、メチルバラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ビリダフェンチオン、ホサン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロバホス、イソフエンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ビラクロホス、モノクロトホス、アシンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ビリミカーブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、EDDP等。

【0087】ビレスロイド系殺虫剤：ペルメトリル、シベルメトリル、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロバトリル、ビレトリル、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリル、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリル、プロトリル、フルバリネット、シフルトリル、シハロトリル、フルシトリネット、エトフェンプロクス、シクロプロトリル、トロラメトリル、シラフルオフェン、プロフェンプロクス、アクリナトリル等。

【0088】ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェシン、ビリブロキシフェン、メトブレン、ベンゾエビン、ジアフェンチウロン、アセタミブリド、イミダクロブリド、ニテンビラム、フィプロニル、カルタップ、チオシクラム、ベニスルタップ、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆蟲病原ウイルス等の微生物農薬等。

【0089】殺線虫剤：フェナミホス、ホスチアゼート等。

【0090】殺ダニ剤：クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ボリナクチン、キノメチオネット、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ビリダベン、フェンピロキシメー

ト、テブフェンビラド、ビリミジフエン、フェノチオカルブ、ジエノクロル、エトキザゾール、ハルフェンプロックス等。

【0091】植物生長調節剤：ジベレリン類（例えばジベレリンA₁、ジベレリンA₂、ジベレリンA₃）、IAA、NAA等。

[0092]

【実施例】次に実施例を挙げて本発明化合物を更に詳細に述べる。

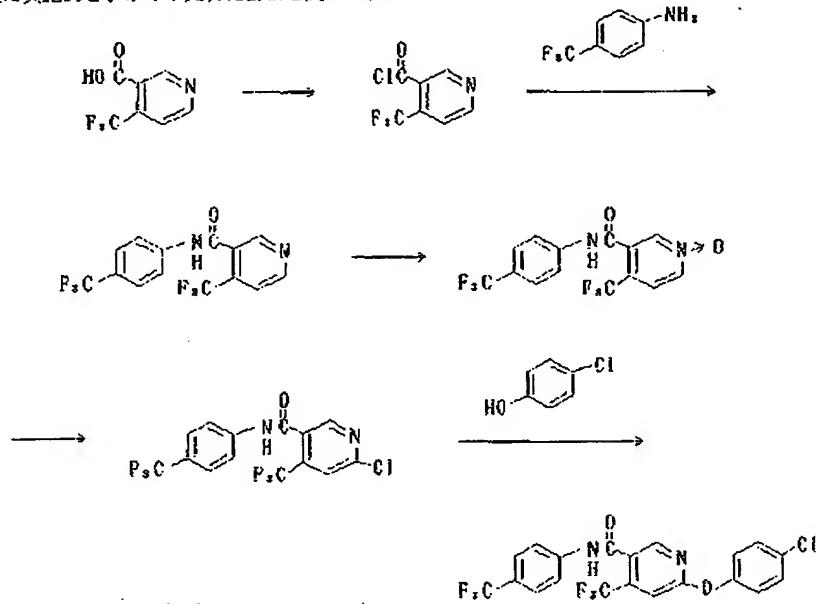
* に説明する。

莫氏傳

6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミド(化合物番号I-60)の製造

[0093]

[化 18]



〔0094〕4-トリフルオロメチル-3-ビリジンカルボン酸2.13gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チオニル3.98gを加えて3時間加熱還流した。反応液を冷却後、減圧濃縮し、残留物をジオキサン20mlに溶解し、トリエチルアミン1.4g及び4-トリフルオロメチルアニリン2.25gを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をヘキサンで洗浄し、4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドを3.3g(収率89%)得た。

〔0095〕次いで、得られた4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミド3.3gをクロロホルム50mlに溶解し、m-クロロ過安息香酸3.65gを加えて、室温で一昼夜攪拌した。反応液を饱和重曹水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮して、4-トリフルオロメチル-3-[N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル]-ビリジン-1-オキシドを1.7g(収率50%)得た。

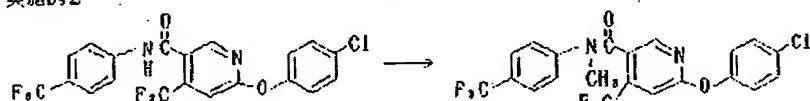
〔0096〕得られた4-トリフルオロメチル-3-

[N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル]-ビリジン-1-オキシド 1.7 g をオキシ塩化リン 20 ml 中で 1 時間加熱還流した。冷却後、反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルと飽和食塩水溶液を加えて分液し、有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル = 10:1) で精製し、6-クラロ-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドを 0.55 g (収率 31%) 得た。

〔0097〕次に、4-クロロフェノール0.1gをDMF 3mlに溶解し、水素化ナトリウムを0.07g加え、反応系内から気体の発生がなくなるまで室温で攪拌した。さらに、6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミド0.27gをDMF 5mlに溶解した液を加え、90°Cで3日間攪拌した。冷却後、反応混合物を水の中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を

た粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、目的物である6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを0.15g(収率4.4%)得た。mp. 162-164°C

【0098】実施例2



【0100】実施例1で得た6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド0.1gをDMF 3mlに溶解し、ヨウ化メチル0.05g及び炭酸カリウム0.05gを加え、室温で一夜攪拌した。反応混合物を水の中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、目的物である6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-※

* 6-(4-クロロフェニルオキシ)-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド(化合物番号1-62)の製造
【0099】
【化19】

* (4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミドを70mg(収率6.7%)得た。

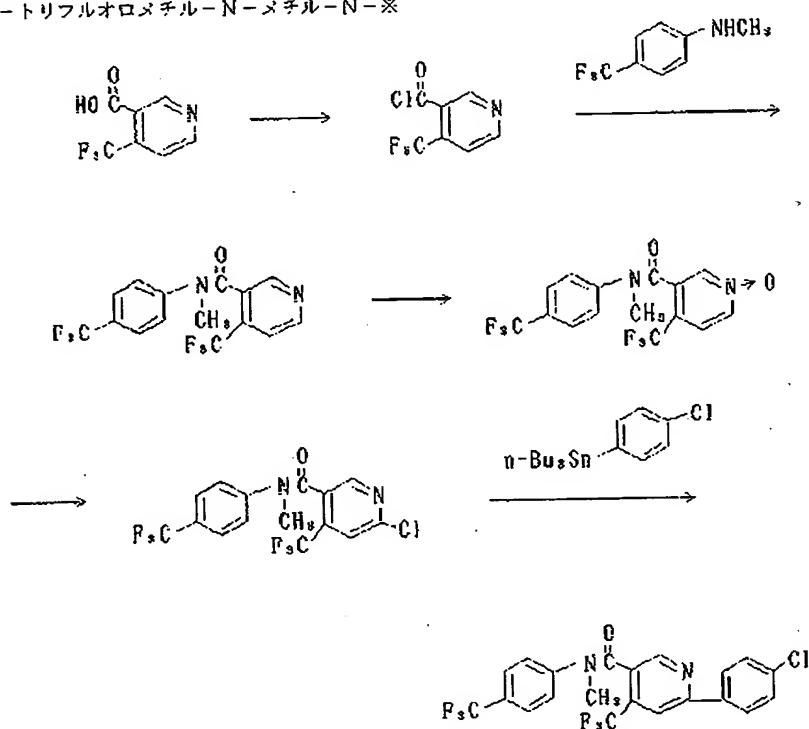
mp. 126-128°C

【0101】実施例3

6-(4-クロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ピリジンカルボキシアミド(化合物番号1-83)の製造

【0102】

【化20】



【0103】4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸2.0gをベンゼン30mlに溶解し、塩化チ

オニル3.74g及びビリジン一滴を加えて、1時間加熱還流した。反応液を冷却し、減圧濃縮した後、残留物をジオキサン20mlに溶解し、トリエチルアミン1.32g及び3.4-ジクロロ-N-メチルアニリン2.3gを加え、室温で4時間搅拌した。反応混合物を減圧濃縮した後、得られた粗結晶をヘキサンで洗浄し、4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドを2.9g(収率79%)得た。

【0104】得られた4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミド2.9gをクロロホルム50mlに溶解し、m-クロロ過安息香酸6.16gを加えて室温で一昼夜搅拌した。反応液を飽和重曹水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、4-トリフルオロメチル-3-(N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル)ビリジン-1-オキシドを3g(収率99%)得た。

【0105】得られた4-トリフルオロメチル-3-[N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル]-ビリジン-1-オキシド3gをオキシ塩化リン20ml中で1時間加熱還流した。冷却後、減圧濃縮し、酢酸エチルと飽和重曹水溶液を加え、洗浄し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-

(3,4-ジクロロフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドを1.36g(収率43%)得た。

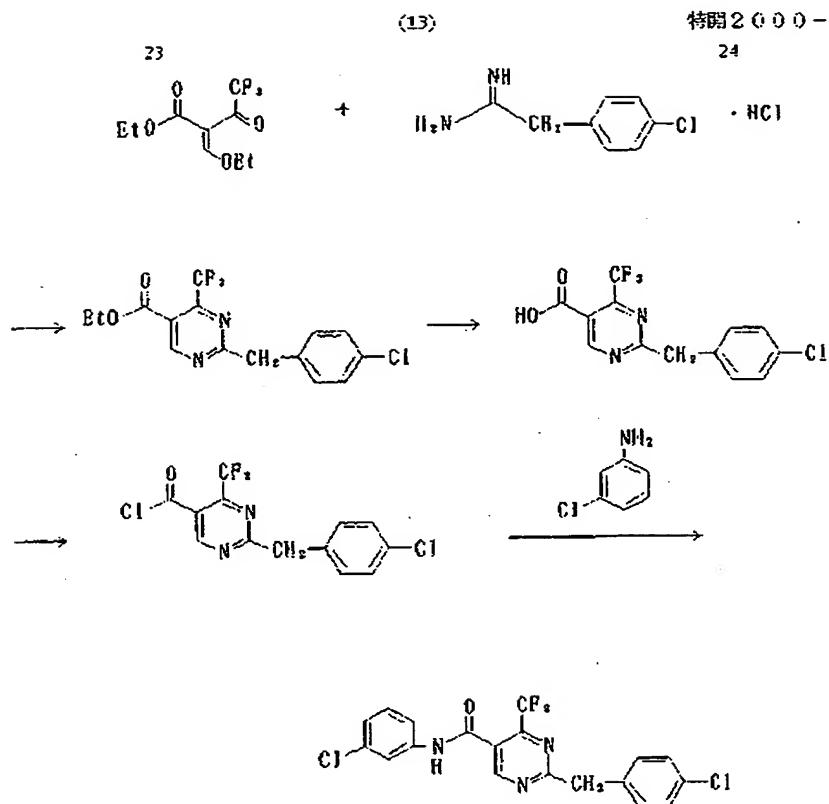
【0106】得られた6-クロロ-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドをジオキサン10mlに溶解し、窒素気流中で、トリ-n-ブチル-(4-クロロフェニル)スズ0.63g、及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)0.17gを加えて2日間加熱還流した。反応液を冷却した後、減圧濃縮し、酢酸エチルを加えて、飽和堿化カリウム水溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、目的物である6-(4-クロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-N-メチル-N-(3,4-ジクロロフェニル)-3-ビリジンカルボキシアミドを0.26g(収率40%)得た。このものの¹H-NMRデータ(NMR-3)を第4表に示す。

【0107】実施例4

2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-N-(3-クロロフェニル)-5-ビリミジンカルボキシアミド(化合物番号I-56)の製造

【0108】

【化21】



【0109】4-クロロフェニルアセトアミジン塩酸塩
 2.05gをエタノール20mLに溶解し、ナトリウム
 エトキシド1.36gを加えた後、さらに、エチル-2-
 -エトキシメチレン-3-オキソ-4,4,4-トリフル
 ルオロブチレート2.58gのエタノール5mL溶液を
 を加え、室温で一夜昼夜攪拌した。反応混合物を氷水水中に
 加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾
 燥した後、減圧浓缩した。得られた粗生成物をシリカゲ
 ルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=
 10:1）で精製し、エチル-2-(4-クロロベンジ
 ル)-4-トリフルオロメチル-5-ビリミジンカルボ
 キシレートを1.2g（收率35%）を得た。

【0110】得られたエチル2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル-5-ビリミジンカルボキシレート1gをメタノール8mlに溶解し、1N-水酸化ナトリウム水溶液を8ml加え、室温で一昼夜搅拌した。反応混合物を氷水中に加え、1N-塩酸8.5mlを加えて酸性とし、析出結晶をろ取することにより、2-(4-クロロベンジル)-4-トリフルオロメチル

-5-ピリミジンカルボン酸を0.87g(収率78%)得た。

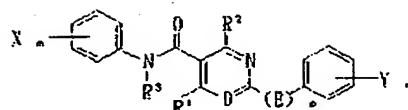
36 [0111] 得られた2-(4-クロロベンジル)-4-トリフォルオロメチル-5-ビリミジンカルボン酸0.4g及び3-クロロアニリン0.19gを酢酸エチル5mlに溶解した後、ジシクロヘキシルカルボシミド0.26gの酢酸エチル5ml溶液を滴下し、室温で4時間攪拌した。反応混合物中から析出物をろ別した後、反応液を1N-塩酸で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた粗結晶をジエチルエーテルで洗浄し、目的物である2-(4-クロロベンジル)-4-トリフォルオロメチル-N-(3-クロロフェニル)-5-ビリミジンカルボキシアミドを0.2g(収率37%)得た。m.p. 151-153°C

40 [0112] 以上の様にして得られる本発明化合物の代表例を第1表～第3表に示す。また、化合物の¹H-NMRデータを第4表にまとめた。

(91131)

[表101]

第 1 表



化合物番号	R¹	R²	R³	(B) .	D	Xₙ	Yₙ	物理値 mp. °C
1-1	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	2-Br	[194-196]
1-2	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	H	[188-190]
1-3	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	2-Cl	[191-192]
1-4	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	2-Cl	[181-182]
1-5	CF₃	H	H	0	N	4-OCF₃	2-Cl	[186-189]
1-6	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	2-CN	[188-179]
1-7	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	2-NO₂	[184-186]
1-8	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	4-Cl	[196-198]
1-9	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	2,6-Cl₂	[192-194]
1-10	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	4-Br	[213-215]
1-11	CF₃	H	H	0	N	4-Cl	2-Me	[188-191]
1-12	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	2-Br	[185-187]
1-13	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	3-Br	[102-104]
1-14	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	3-Me	[189-192]
1-15	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	H	[201-203]
1-16	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	2,4-Cl₂	[211-212]
1-17	CF₃	H	H	0	N	4-CF₃	3,4-Cl₂	[204-207]

[0114]

【表102】

第 1 表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	X ₁	Y ₁	物理値 mp. °C
I-18	CF ₃	H	H	O	H	4-CF ₃	3-CF ₃	[175-178]
I-19	CF ₃	H	H	O	H	4-CF ₃	3-Cl	[185-187]
I-20	CF ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-Cl	[161-162]
I-21	CF ₃	H	H	O	H	4-Cl	2-i	[200-201]
I-22	CF ₃	H	H	O	H	4-Ph	4-Cl	[233-235]
I-23	CF ₃	H	H	O	H	4-CF ₃	4-Cl	[198-200]
I-24	CF ₃	H	H	O	H	4-OCP ₃	H	[180-182]
I-25	CF ₃	H	H	O	H	4-OCP ₃	2-CN	[161-163]
I-26	CF ₃	H	H	O	H	3-CF ₃	2-Cl	[134-137]
I-27	CF ₃	H	H	O	H	3-CF ₃	4-Cl	[122-125]
I-28	CF ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-Br	[155-157]
I-29	CF ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-F-3-CF ₃	[185-187]
I-30	CF ₃	H	H	O	H	4-F-3-CF ₃	4-Br	[163-165]
I-31	CF ₃	H	H	O	H	2,4-F ₂	4-Br	[165-167]
I-32	CF ₃	H	H	O	H	2,6-Cl ₂	4-Br	[234-236]
I-33	CF ₃	H	H	O	H	3-Cl	H	[143-145]
I-34	CF ₃	H	H	O	H	4-CF ₃	4-Ph	[213-214]
I-35	CF ₃	H	H	O	H	5-Cl-2-OMs	H	[126-128]
I-36	CF ₃	H	H	O	H	5-Cl-2-OH	H	[201-203]
I-37	CF ₃	H	H	O	H	3,4-Cl ₂	4-Cl	[161-163]

* OMs:OSO₂CH₃

第1表(続巻)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(B)	D	X	Y	物性値 mp. °C
1-38	CF ₃	H	CH ₃	O	N	4-Cl	4-Cl	[103-105]
1-39	CF ₃	H	CH ₃	O	N	4-Cl	2-Cl	[112-114]
1-40	CF ₃	H	CH ₃	O	N	4-Cl	4-Br	[137-140]
1-41	CF ₃	H	CH ₃	O	N	4-Cl ₂	4-Br	[142-144]
1-42	CF ₃	H	CH ₃	O	N	3-Cl	4-Cl	NMR-1
1-43	CF ₃	H	CH ₃	O	N	3,4-Cl ₂	4-Cl	[188-90]
1-44	CF ₃	H	OH	O	N	4-Cl	4-Cl	[198-200]
1-45	CF ₃	H	OH	O	N	4-Cl	4-Br	[188-189]
1-46	CH ₃	H	H	O	N	4-Cl ₂	2-Cl	[183-188]
1-47	CH ₃	H	H	O	N	4-Cl ₂	2-CN	[162-184]
1-48	CF ₃ H	H	H	O	N	3-Cl	4-Br	[112-114]
1-49	CF ₃ H	H	H	O	N	3-Cl	4-Cl	[149-151]
1-50	CF ₃ Cl	H	H	O	N	4-Cl ₂	4-Cl	[168-170]
1-51	CF ₃ Cl	H	H	O	N	4-Cl ₂	4-Br	[188-190]
1-52	CF ₂ Cl	H	H	O	N	4-Cl	4-Br	[188-190]
1-53	CF ₂ Cl	H	H	O	N	3-Cl	4-Cl	[137-139]
1-54	CF ₂ Cl	H	H	O	N	3-Cl	4-Br	[128-130]
1-55	CF ₃	H	H	CH ₂	N	4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	[202-203]
1-56	CF ₃	H	H	CH ₃	N	3-Cl	4-Cl	[151-153]
1-57	CF ₃	H	H	C=O	N	3-Cl	4-Cl	[204-205]

[0116]

[表104]

第1表(続表)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(D)	D	Z	Y	物性値 mp. °C
1-58	CF ₃	H	H	O	CH	3-Cl	H	[151-159]
1-59	CF ₃	H	H	O	CH	3,4-Cl ₂	4-Cl	[153-155]
1-60	CF ₃	H	H	O	CH	4-CP ₃	4-Cl	[162-164]
1-61	CP ₃	H	H	O	CH	4-CP ₃	3,4-Cl ₂	[162-164]
1-62	CP ₃	H	CH ₃	O	CH	4-CP ₃	4-Cl	[126-128]
1-63	CP ₃	H	CH ₃	O	CH	4-CP ₃	3,4-Cl ₂	[112-114]
1-64	CF ₃	H	CH ₃	O	H	4-CH ₃	4-Cl	[110-112]
1-65	CP ₃	H	H	O	H	4-CH ₃	4-Cl	[200-202]
1-66	CP ₃	H	OCH ₃	O	H	3,4-Cl ₂	4-Cl	[58-60]
1-67	CF ₃	H	H	O	H	2-Ph	4-Cl	[173-174]
1-68	CP ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-NO ₂	
1-69	CP ₃	H	H	O	H	3-CP ₃	4-Cl	
1-70	CP ₃	H	H	O	H	4-OCOCH ₃	4-Cl	
1-71	CP ₃	H	H	O	H	4-OCOCH ₃	4-Br	
1-72	CP ₃	H	H	O	H	4-Cl	4-SBu ⁺	
1-73	CP ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-OH	
1-74	CP ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-OBu ⁺	
1-75	CP ₃	H	H	O	H	4-CP ₃	2,6-Cl ₂	
1-76	CP ₃	H	H	O	N	2-CONMe ₂	4-Br	
1-77	CF ₃	H	H	O	N	3-Cl	4-OCF ₃	

第 1 表(焼き)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(S)	O	I _n	S	物理値 mp. °C
I-78	CP ₃	H	H	結合	N	4-CP ₃	4-Cl-Ph	[206-207]
I-79	CP ₃	H	H	結合	N	4-CP ₃	2,6-F ₂ -Ph	[220]
I-80	CP ₃ ,Cl	H	H	結合	N	4-CP ₃	4-Cl-Ph	[176-181]
I-81	CP ₃	H	H	結合	H	4-CP ₃	- (n=0)	
I-82	CP ₃	H	CH ₃	結合	CH	3,4-Cl ₂	Ph	NMR-2
I-83	CP ₃	H	CH ₃	結合	CH	3,4-Cl ₂	4-Cl	NMR-3
I-84	CP ₃	CH ₃	H	結合	CH	4-CP ₃	-	
I-85	CH	H	H	O	N	4-CH ₃	4-Cl	
I-86	Br	H	H	O	N	3,4-Cl ₂	4-Cl	
I-87	OCP ₃	H	H	O	N	2-Cl	4-Cl	
I-88	OCH ₃	H	H	O	N	2-Cl	4-Cl	
I-89	NO ₂	H	H	O	N	3-Br	4-Cl	
I-90	CH ₃	H	H	O	N	4-CH	4-Cl	
I-91	H	H	H	O	N	4-Cl	4-Br	
I-92	CN	H	H	O	CH	4-CH ₃	4-Cl	
I-73	Br	H	H	O	CH	3,4-Cl ₂	4-Cl	
I-94	OCP ₃	H	H	O	CH	2-Cl	4-Cl	
I-95	OCH ₃	H	H	O	CH	2-Cl	4-Cl	
I-96	NO ₂	H	H	O	CH	3-Br	4-Cl	
I-97	OPh	H	H	O	CH	4-Cl	4-Cl	
I-98	4-Cl-Ph	H	H	O	N	4-Cl	4-Cl	
I-100	4-Cl-Ph	H	H	O	CH	4-Cl	4-Cl	

(注) 結合とは、p = 0 を表す(以下の表にて同じ。)

第 1 表(続き)

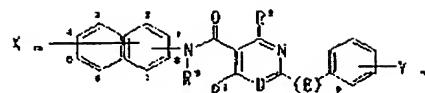
化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(R) ₂	Y	X -	Z -	物理値 mp. °C
I-101	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₃	CH	3-Cl	H	
I-102	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₃	H	3,4-Cl ₂	4-Cl	
I-103	CF ₃	H	H	O	CH	2-OCF ₃	3-NO ₂	
I-104	CF ₃	H	H	O	H	4-ClF ₃	4-ND ₃	
I-105	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	4-ClF ₃	4-SO ₃	
I-106	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	4-ClF ₃	4-SO ₂ CH ₃	
I-107	CF ₃	H	CH ₃	O	H	4-ClF ₃	4-cPr	
I-108	CF ₃	H	H	O	H	4-CH ₃	4-SC ₂ H ₅	
I-109	CF ₃	H	OCH ₃	O	H	3,4-Cl ₂	2-CH ₃	
I-110	CF ₃	H	H	O	CH	3,4-Cl ₂	2-CH ₃	
I-111	CF ₃	H	H	O	H	4-SO ₂ Bu ^t	4-Cl	
I-106	CF ₃	H	H	O	CH	4-SO ₂ Bu ^t	4-Cl	
I-107	CF ₃	H	H	O	H	4-OCH ₃	4-Cl	
I-108	CF ₃	H	H	O	CH	4-OCH ₃	4-Cl	
I-111	CF ₃	H	H	O	H	4-cHex	4-SBu ^t	
I-112	CF ₃	H	H	O	CH	4-cHex	4-SBu ^t	
I-113	CF ₃	H	H	O	H	3-Cl	4-OBu ^t	
I-114	OH	H	H	O	H	4-ClF ₃	2,6-Cl ₂	
I-115	OH	H	H	O	CH	4-Cl	2-COMe ₂	
I-116	cPr	H	H	O	H	3-Cl	4-OCF ₃	
I-117	CF ₃	H	cPr	O	H	3-Cl	4-OCF ₃	

* cPr : シクロプロピル基

【0119】

【表201】

城 2 表



化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E), Z	D	Nの 結合	X =	T _p	物性値 mp. °C
2-1	CF ₃	H	H	0	N	1	- (m=0)	4-CI	
2-2	CF ₃	H	H	0	CH	1	4-CI	2-CI	
2-3	CF ₃	H	H	0	N	1	7-CI	2-CI	
2-4	CF ₃	H	H	0	CH	1	7-CI	2-CI	
2-5	CF ₃	H	H	0	N	1	2-CI	4-OCF ₃	
2-6	CF ₃	H	H	0	CH	1	2-CI	4-OCF ₃	
2-7	CF ₃	H	H	0	N	1	4-CI	2-NO ₂	
2-8	CF ₃	H	H	0	CH	1	4-CI	2-NO ₂	
2-9	CF ₃	H	H	0	N	1	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
2-10	CF ₃	H	H	0	CH	1	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
2-11	CF ₃	H	H	0	N	1	4-CI	2-Me	
2-12	CF ₃	H	H	0	CH	1	4-CI	2-Me	
2-13	CF ₃	H	H	0	N	1	4-CF ₃	3-CN	
2-14	CF ₃	H	H	0	CH	1	4-CF ₃	3-CN	
2-15	CF ₃	H	H	0	N	1	7-CF ₃	H	
2-16	CF ₃	H	H	0	CH	1	7-CF ₃	H	

(注) 「Nの結合」とは、N-R³基のナフチル基に結合する位置を示す。
(以下の表にて同じ。)

第 2 表(続)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	B	Nの結合	I	T _g	物性値 mp. °C
2-17	CF ₃	H	H	O	N	1	4-CF ₃	3-OH	
2-18	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-CF ₃	3-OH	
2-19	CF ₃	H	H	O	H	1	3-Cl	4-COCH ₃	
2-20	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	4-COCH ₃	
2-21	CF ₃	H	H	O	N	1	2-Cl	4-Ph	
2-22	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-Cl	4-Ph	
2-23	CF ₃	H	H	O	N	1	4-CF ₃	4-OOCCH ₃	
2-24	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-CF ₃	4-OOCCH ₃	
2-25	CF ₃	H	H	O	N	1	3-Cl	4-C(=O)NMe ₂	
2-26	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	4-C(=O)NMe ₂	
2-27	CF ₃	H	H	O	N	1	3-Cl	4-Br	
2-28	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-Cl	P-3-CF ₃	
2-29	CF ₃	H	H	O	N	1	P-3-CF ₃	4-Br	
2-30	CF ₃	H	H	O	CH	1	2,4-P ₂	4-Br	
2-31	CF ₃	H	H	O	N	1	2,6-Cl ₂	4-Br	
2-32	CF ₃	H	H	O	N	1	3-Cl	4-SCH ₃	
2-33	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-Cl	4-SCH ₃	
2-34	CF ₃	H	H	O	N	1	3-Cl	2-OMs	
2-35	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-Cl	2-OMs	

† OMs:OSO₂CH₃

第2表(続)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性 mp. °C
2-36	CF ₃	H	CH ₃	O	N	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-37	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-38	CF ₃	H	CO ₂	O	N	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-39	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-40	CF ₃	H	CH ₃	O	N	1	2-CH	4-Cl	
2-41	CF ₃	H	CN ₂	O	CH	1	2-CH	4-Cl	
2-42	CF ₃	H	OR	O	N	1	2-OR	4-Cl	
2-43	CF ₃	H	OR	O	CH	1	2-OR	4-F	
2-44	CH ₃	H	H	O	N	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-45	CH ₃	H	H	O	CH	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-46	CF ₃ H	H	H	O	N	1	2-OCH ₃	4-Br	
2-47	CF ₃ H	H	H	O	CH	1	2-OCH ₃	4-Br	
2-48	CF ₃ Cl	H	H	O	N	1	7-ClF ₃	4-Cl	
2-49	CF ₃ Cl	H	H	O	CH	1	7-ClF ₃	4-Cl	
2-50	CF ₃ Cl	H	H	O	N	1	2-SCH ₃	4-Br	
2-51	CF ₃ Cl	H	H	O	CH	1	2-SCH ₃	4-Cl	
2-52	CF ₃ Cl	H	H	O	N	1	2-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-53	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-54	CF ₃	H	H	O	N	1	2-COCH ₃	4-Cl	
2-55	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-COCH ₃	4-Cl	

【0122】

【表204】

第2表(続)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの結合	X-	Y-	物性値 mp. °C
2-56	CF ₃	H	H	O	N	1	3-cPr	H	
2-57	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-cPr	4-Cl	
2-58	CF ₃	H	H	O	H	1	5-OCOCH ₃	4-Cl	
2-59	CF ₃	H	H	O	CH	1	5-OCOCH ₃	4-Cl	
2-60	CF ₃	H	CH ₃	O	H	1	4-OMs	4-Cl	
2-61	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	1	4-OMs	3,4-Cl ₂	
2-62	CF ₃	H	CH ₃	O	N	1	2-Ph	4-Cl	
2-63	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-Ph	4-Cl	
2-64	CF ₃	H	OCH ₃	O	N	1	5-NO ₂	4-Cl	
2-65	CF ₃	H	H	O	CH	1	5-NO ₂	4-Cl	
2-66	CF ₃	H	H	O	N	1	3-CN	4-NO ₂	
2-67	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-cHex	4-Cl	
2-68	CF ₃	H	H	O	N	1	4-COCH ₃	4-Cl	
2-69	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-OCOCH ₃	4-Br	
2-70	CF ₃	H	H	O	N	1	2-COMe ₂	4-SBu ⁺	
2-71	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-COMe ₂	4-OH	
2-72	CF ₃	H	H	O	N	1	3-Cl	4-OBu ⁺	
2-73	CF ₃	H	cPr	O	CH	1	4-CP ₃	2,6-Cl ₂	
2-74	CF ₃	H	H	O	N	1	2-COMe ₂	4-Br	
2-75	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-Cl	4-OCF ₃	

[0123]

【表205】

第2表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	R	Nの 結合	X -	Y _n	物性 mp. °C
2-76	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Cl	2-Cl	
2-77	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	2-Cl	
2-78	CF ₃	H	H	O	N	2	7-Cl	2-Cl	
2-79	CF ₃	H	H	O	CH	2	7-Cl	2-Cl	
2-80	CF ₃	H	H	O	N	2	2-Cl	4-OCF ₃	
2-81	CF ₃	H	H	O	CH	2	1-Cl	4-OCF ₃	
2-81	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Cl	2-NO ₂	
2-83	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	2-NO ₂	
2-84	CF ₃	H	H	O	H	2	1,6-Cl ₂	4-OCF ₃	
2-85	CF ₃	H	H	O	CH	2	1,6-Cl ₂	4-OCF ₃	
2-86	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Cl	2-Me	
2-87	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	2-Me	
2-88	CF ₃	H	H	O	N	2	4-OCF ₃	3-CN	
2-89	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-OCF ₃	3-CN	
2-90	CF ₃	H	H	O	N	2	7-OCF ₃	11	
2-91	CF ₃	H	H	O	CH	2	7-OCF ₃	H	

[0124]

【表206】

第2表(続)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの結合	X =	Y =	物理値 mp. °C
2-92	CF ₃	H	H	O	N	2	4-CF ₃	3-OH	
2-93	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-CF ₃	3-OH	
2-94	CF ₃	H	H	O	N	2	3-Cl	4-COCH ₃	
2-95	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	4-COCH ₃	
2-96	CF ₃	H	H	O	N	2	1-Cl	4-Ph	
2-97	CF ₃	H	H	O	CH	2	1-Cl	4-Ph	
2-98	CF ₃	H	H	O	N	2	4-CF ₃	4-OCOCH ₃	
2-99	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-CF ₃	4-OCOCH ₃	
2-100	CF ₃	H	H	O	N	2	3-Cl	4-COMe ₂	
2-101	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	4-COMe ₂	
2-102	CF ₃	H	H	O	N	2	3-Cl	4-Br	
2-103	CF ₃	H	H	O	CH	2	3-Cl	F-3-CF ₃	
2-104	CF ₃	H	H	O	N	2	F-3-CF ₃	4-Br	
2-105	CF ₃	H	H	O	CH	2	1,4-F ₂	4-Br	
2-106	CF ₃	H	H	O	N	2	1,6-Cl ₂	4-Br	
2-107	CF ₃	H	H	O	H	2	3-Cl	SCH ₃	
2-108	CF ₃	H	H	O	CH	2	3-Cl	SCH ₃	
2-109	CF ₃	H	H	O	N	2	3-Cl	2-Oms	
2-110	CF ₃	H	H	O	CH	2	3-Cl	2-Oms	

† Oms:OSO₂CH₃

[0125]

39 [表207]

第2表(続)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(G)	D	Nの 結合	X _m	Y _n	物理値 mp. °C
2-111	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-112	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-113	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-114	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-115	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	1-CN	4-Cl	
2-116	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	1-CN	4-Cl	
2-117	CF ₃	H	OH	O	N	2	7-OH	4-Cl	
2-118	CF ₃	H	OH	O	CH	2	7-OH	4-Br	
2-119	CH ₃	H	H	O	N	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-120	CH ₃	H	H	O	CH	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-121	CF ₂ H	H	H	O	N	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-122	CF ₂ H	H	H	O	CH	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-123	CF ₂ Cl	H	H	O	N	2	7-CP ₃	4-Cl	
2-124	CF ₂ Cl	H	H	O	CH	2	7-CP ₃	4-Cl	
2-125	CF ₂ Cl	H	H	O	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-126	CF ₂ Cl	H	H	O	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-127	CF ₂ Cl	H	H	O	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-128	CF ₃	H	H	O	CH	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-129	CF ₃	H	H	O	N	2	7-COCH ₃	4-Cl	
2-130	CF ₃	H	H	O	CH	2	7-COCH ₃	4-Cl	

[0126]

[表208]

第2表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの 結合	I	R ₄	物性値 mp. °C
2-131	CF ₃	H	CH ₃	結合	H	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-132	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-133	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-134	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-135	CF ₃	H	CH ₃	結合	H	1	2-CN	4-Cl	
2-136	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	2-CN	4-Cl	
2-137	CF ₃	H	OH	結合	H	1	7-OH	4-Cl	
2-138	CF ₃	H	OH	結合	CH	1	7-OH	4-P	
2-139	CH ₃	H	H	結合	H	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-140	CH ₃	H	H	結合	CH	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-141	CF ₂ H	H	H	結合	H	1	7-OCH ₃	4-Br	
2-142	CF ₂ H	H	H	結合	CH	1	7-OCH ₃	4-Br	
2-143	CF ₂ Cl	H	H	結合	H	1	7-CP ₃	4-Cl	
2-144	CF ₂ Cl	H	H	結合	CH	2	7-CP ₃	4-Cl	
2-145	CF ₂ Cl	H	H	結合	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-146	CF ₂ Cl	H	H	結合	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-147	CF ₂ Cl	H	H	結合	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-148	CF ₃	H	H	結合	CH	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-149	CF ₃	H	H	結合	N	2	7-COCH ₃	4-Cl	
2-150	CF ₃	H	H	結合	CH	2	7-COCH ₃	4-Cl	

[0127]

[表209]

第2表(焼き)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(G)	D	Nの結合	X =	T _g	物性値 mp. °C
2-151	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-152	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-153	CF ₃	H	CH ₃	結合	W	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-154	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-155	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	2	1-CN	4-Cl	
2-156	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	2	1-CN	4-Cl	
2-157	CF ₃	H	OH	結合	N	2	7-OH	4-Cl	
2-158	CF ₃	H	OH	結合	CH	2	7-OH	4-Br	
2-159	CH ₃	H	H	結合	N	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-160	CH ₃	H	H	結合	CH	1	9-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-161	CF ₃ H	H	H	結合	N	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-162	CF ₃ H	H	H	結合	CH	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-163	CF ₃ Cl	H	Cl	結合	N	2	7-Cl	4-Cl	
2-164	CF ₃ Cl	H	Cl	結合	CH	2	7-Cl	4-Cl	
2-165	CF ₃ Cl	H	H	結合	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-166	CF ₃ Cl	H	H	結合	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-167	CF ₃ Cl	H	H	結合	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-168	CF ₃	H	H	結合	CH	2	7-SO ₂ CH ₂	4-Br	
2-169	CF ₃	H	H	結合	N	1	7-COCH ₃	4-Cl	
2-170	CF ₃	H	H	結合	CH	1	7-COCH ₃	4-Cl	

[0128]

[表210]

第2表(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(B)	D	Nの結合	T _m	T _s	物性値 n _D °C
2-171	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	Y	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-172	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-173	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	Y	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-174	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-175	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	H	1	2-CN	4-Cl	
2-176	CP ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	1	2-CN	4-Cl	
2-177	CP ₃	H	OH	CH ₂	Y	1	7-OH	4-Cl	
2-178	CP ₃	H	OH	CH ₂	CH	1	7-OH	4-Br	
2-179	CH ₃	H	H	CH ₂	N	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-180	CH ₃	H	H	CH ₂	CH	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-181	CF ₃ H	H	H	CH ₂	N	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-182	CF ₃ H	H	H	CH ₂	CH	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-183	CP ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	2	7-CF ₃	4-Cl	
2-184	CP ₃ Cl	H	H	CH ₂	CH	2	7-CF ₃	4-Cl	
2-185	CP ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-186	CH ₃ Cl	H	H	CH ₂	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-187	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-188	CF ₃	H	H	CH ₂	CH	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-189	CP ₃	H	H	CH ₂	N	2	7-COCH ₃	4-Cl	
2-190	CP ₃	H	H	CH ₂	CH	2	7-COCH ₃	4-Cl	

[0129]

【表211】

第2表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの 結合	X ₁	Y ₁	物理性 mp. °C
2-181	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	N	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-192	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-193	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	N	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-194	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-195	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	N	2	1-CH	4-Cl	
2-196	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂	CH	2	1-CH	4-Cl	
2-197	CF ₃	H	OH	CH ₂	N	1	7-OH	4-Cl	
2-198	CF ₃	H	OH	CH ₂	CH	1	7-OH	4-F	
2-199	CH ₃	H	H	CH ₂	N	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-200	CH ₃	H	H	CH ₂	CH	1	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-201	CF ₃ H	H	H	CH ₂	N	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-202	CF ₃ H	H	H	CH ₂	CH	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-203	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	1	7-CF ₃	4-Cl	
2-204	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	CH	1	7-CF ₃	4-Cl	
2-205	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	1	6-SCH ₃	4-Br	
2-206	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	CH	1	6-SCH ₃	4-Cl	
2-207	CF ₃ Cl	H	H	CH ₂	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-208	CF ₃	H	H	CH ₂	CH	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-209	CF ₃	H	H	CH ₂	N	1	7-COCH ₃	4-Cl	
2-210	CF ₃	H	H	CH ₂	CH	1	7-COCH ₃	4-Cl	

【0130】

【表212】

第2表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(Z)	D	Nの 結合	X	Y	物性 mp. °C
2-211	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-212	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-213	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-214	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	1	3-Cl	4-Br-Ph	
2-215	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	1-CH	4-Cl	
2-216	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	1-CH	4-Cl	
2-217	CF ₃	H	Br	CO	N	1	7-OH	4-Cl	
2-218	CF ₃	H	OH	CO	CH	1	7-OH	4-Br	
2-219	CH ₃	H	H	CO	N	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-220	CH ₃	H	H	CO	CH	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-221	CF ₃ H	H	H	CO	N	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-222	CF ₃ H	H	H	CO	CH	2	7-OCH ₃	4-Br	
2-223	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	7-CF ₃	4-Cl	
2-224	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	7-CF ₃	4-Cl	
2-225	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-226	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-227	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-228	CF ₃	H	H	CO	CH	2	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-229	CF ₃	H	H	CO	N	1	7-COCH ₃	4-Cl	
2-230	CF ₃	H	H	CO	CH	1	7-COCH ₃	4-Cl	

【0131】

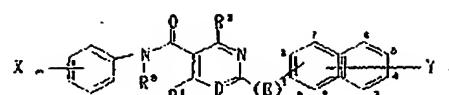
【表213】

第2表(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(B) >	B	Nの結合	X _n	Y _n	物理性 mp. °C
2-231	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-232	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	1	3-Cl	4-SO ₂ CH ₃	
2-233	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-234	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	3-Cl	4-Br-Ph	
2-235	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	1-CN	4-Cl	
2-236	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	1-CN	4-Cl	
2-237	CF ₃	H	OH	CO	N	1	7-OH	4-Cl	
2-238	CF ₃	H	OH	CO	CH	1	7-OH	4-Br	
2-239	CH ₃	H	H	CO	N	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-240	CH ₃	H	H	CO	CH	2	3-C ₂ H ₅	2-Cl	
2-241	CF ₂ H	H	H	CO	N	1	7-OCH ₃	4-Br	
2-242	CF ₂ H	H	H	CO	CH	1	7-OCH ₃	4-Br	
2-243	CF ₂ Cl	H	H	CO	H	2	7-CP ₂	4-Cl	
2-244	CF ₂ Cl	H	H	CO	CH	2	7-CP ₂	4-Cl	
2-245	CF ₂ Cl	H	H	CO	N	2	6-SCH ₃	4-Br	
2-246	CF ₂ Cl	H	H	CO	CH	2	6-SCH ₃	4-Cl	
2-247	CF ₂ Cl	H	H	CO	N	1	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-248	CF ₃	H	H	CO	CH	1	7-SO ₂ CH ₃	4-Br	
2-249	CF ₃	H	H	CO	N	1	7-COCH ₃	4-Cl	
2-250	CF ₃	H	H	CO	CH	1	7-COCH ₃	4-Cl	

【0132】

【表301】



化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(B)	D	結合 位置	Y	Y ₁	物理値 bp. ℃
3-1	CF ₃	H	H	O	N	1	2-Cl	4-Cl	
3-2	CF ₃	R	H	O	CH	1	2-Cl	4-Cl	
3-3	CF ₃	H	H	O	N	1	2-Cl	7-Cl	
3-4	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-Cl	7-Cl	
3-5	CF ₃	H	H	O	N	1	4-OCF ₃	2-Cl	
3-6	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-OCF ₃	2-Cl	
3-7	CF ₃	R	H	O	N	1	2-NO ₂	4-Cl	
3-8	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-NO ₂	4-Cl	
3-9	CF ₃	H	H	O	N	1	4-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
3-10	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
3-11	CF ₃	H	H	O	N	1	2-Me	4-Cl	
3-12	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-Me	4-Cl	
3-13	CF ₃	H	H	O	N	1	3-CN	4-OCF ₃	
3-14	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-CN	4-OCF ₃	
3-15	CF ₃	H	H	O	N	1	H	7-Cl ₃	
3-16	CF ₃	H	H	O	CH	1	H	7-Cl ₃	

[0133]

[表302]

第3表(総合)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(D)	D	Nの結合	I _n	Y _n	物性値 mp. °C
3-17	CF ₃	H	H	O	R	1	3-OH	4-CF ₃	
3-18	CF ₃	H	H	O	CH	1	3-OH	4-CF ₃	
3-19	CF ₃	H	H	O	R	1	4-COCH ₃	3-Cl	
3-20	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-COCH ₃	4-Cl	
3-21	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Ph	2-Cl	
3-22	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Ph	2-Cl	
3-23	CF ₃	H	H	O	N	1	4-COCH ₃	4-CF ₃	
3-24	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-COCH ₃	4-CF ₃	
3-25	CF ₃	H	H	O	N	1	4-CORMe ₂	3-Cl	
3-26	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-CORMe ₂	4-Cl	
3-27	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Br	3-Cl	
3-28	CF ₃	H	H	O	CH	1	6-3-CF ₃	3-Cl	
3-29	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Br	2,3-CF ₃	
3-30	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Br	2,4-F ₂	
3-31	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Br	2,6-Cl ₂	
3-32	CF ₃	H	H	O	N	1	SCH ₃	3-Cl	
3-33	CF ₃	H	H	O	CH	1	SCH ₃	3-Cl	
3-34	CF ₃	H	H	O	N	1	2-OMs	3-Cl	
3-35	CF ₃	H	H	O	CH	1	2-OMs	3-Cl	

(注) OMs:OSO₂CH₃を表す。

第3表(総合)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(B)	R	Nの 結合	I _m	T _a	物性値 pp. °C
3-36	CP ₂	H	CH ₃	O	R	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-37	CP ₂	H	CH ₃	O	CH	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-38	CP ₂	H	CH ₃	O	R	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-39	CP ₂	H	CH ₃	O	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-40	CP ₂	H	CH ₃	O	R	1	4-Cl	2-CH	
3-41	CP ₂	H	CH ₃	O	CH	1	4-Cl	2-CH	
3-42	CP ₂	H	OK	O	R	1	4-Cl	2-OH	
3-43	CP ₂	H	OB	O	CH	1	4-F	2-OH	
3-44	CH ₃	H	H	O	H	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-45	CH ₃	H	H	O	CH	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-46	CP ₂ H	H	H	O	N	1	4-Br	2-OCH ₃	
3-47	CP ₂ H	H	H	O	CH	1	4-Br	2-OCH ₃	
3-48	CP ₂ Cl	H	H	O	N	1	4-Cl	7-CP ₂	
3-49	CP ₂ Cl	H	H	O	CH	1	4-Cl	7-CP ₂	
3-50	CP ₂ Cl	H	H	O	N	1	4-Br	2-SCH ₃	
3-51	CP ₂ Cl	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-SCH ₃	
3-52	CP ₂ Cl	H	H	O	N	1	4-Br	2-SO ₂ CH ₃	
3-53	CP ₂	H	H	O	CH	1	4-Br	2-SO ₂ CH ₃	
3-54	CP ₂	H	H	O	N	1	4-Cl	2-COCH ₃	
3-55	CP ₂	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-COCl ₂	

[0135]

【表304】

第3表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	B	Nの 結合	L	Y	物理性 質 mp. °C
3-56	CF ₃	H	H	O	N	1	H	3-cPr	
3-57	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	3-cPr	
3-58	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Cl	5-OCOCH ₃	
3-59	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	5-OCOCH ₃	
3-60	CF ₃	H	CH ₃	O	N	1	4-Cl	4-OMs	
3-61	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	1	3,4-Cl ₂	4-OMs	
3-62	CF ₃	H	CH ₃	O	H	1	4-Cl	2-Ph	
3-63	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	2-Ph	
3-64	CF ₃	H	OCH ₃	O	H	1	4-Cl	5-NO ₂	
3-65	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	5-NO ₂	
3-66	CF ₃	H	H	O	N	1	4-NO ₂	3-CN	
3-67	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Cl	3-cHex	
3-68	CF ₃	H	H	O	H	1	4-Cl	4-COCH ₃	
3-69	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-Br	4-OCOCH ₃	
3-70	CF ₃	H	H	O	N	1	4-SBu	2-COMe ₂	
3-71	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-OB	2-COMe ₂	
3-72	CF ₃	H	H	O	N	1	4-OBu	3-Cl	
3-73	CF ₃	H	cPr	O	CH	1	2,6-Cl ₂	4-CP ₃	
3-74	CF ₃	H	H	O	N	1	4-Br	2-COMe ₂	
3-75	CF ₃	H	H	O	CH	1	4-OCF ₃	3-Cl	

[0136]

【表305】

第3表(続)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(R) ₂	R	Nの 結合	X ₁	X ₂	物理値 mp. °C
3-76	CF ₃	H	H	0	N	2	2-Cl	4-Cl	
3-77	CF ₃	H	H	0	CH	2	2-Cl	4-Cl	
3-78	CF ₃	H	H	0	N	2	2-Cl	7-Cl	
3-79	CF ₃	H	H	0	CH	2	2-Cl	7-Cl	
3-80	CF ₃	H	H	0	N	2	4-OCF ₃	2-Cl	
3-81	CF ₃	H	H	0	CH	2	4-OCF ₃	1-Cl	
3-82	CF ₃	H	H	0	N	2	2-NO ₂	4-Cl	
3-83	CF ₃	H	H	0	CH	2	2-NO ₂	4-Cl	
3-84	CF ₃	H	H	0	N	2	4-OCF ₃	1,6-Cl ₂	
3-85	CF ₃	H	H	0	CH	2	4-OCF ₃	1,6-Cl ₂	
3-86	CF ₃	H	H	0	N	2	2-Me	4-Cl	
3-87	CF ₃	H	H	0	CH	2	2-Me	4-Cl	
3-88	CF ₃	H	H	0	N	2	3-CN	4-OCF ₃	
3-89	CF ₃	H	H	0	CH	2	3-CN	4-OCF ₃	
3-90	CF ₃	H	H	0	N	2	H	7-OCF ₃	
3-91	CF ₃	H	H	0	CH	2	H	7-OCF ₃	

[0137]

【表306】

第3表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの 結合	X	Y	物性値 mp. °C
3-92	CF ₃	H	H	O	N	2	3-OH	4-CF ₃	
3-93	CF ₃	H	H	O	CH	2	3-OH	4-CF ₃	
3-94	CF ₃	H	H	O	N	2	4-COCH ₃	3-Cl	
3-95	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-COCH ₃	4-Cl	
3-96	CF ₃	H	H	O	H	2	4-Ph	1-Cl	
3-97	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Ph	1-Cl	
3-98	CF ₃	H	H	O	N	2	4-OOCCH ₃	4-CF ₃	
3-99	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-OOCCH ₃	4-CF ₃	
3-100	CF ₃	H	H	O	N	2	4-COCH ₃	3-Cl	
3-101	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-COCH ₃	4-Cl	
3-102	CF ₃	H	H	O	H	2	4-Br	3-Cl	
3-103	CF ₃	H	H	O	CH	2	F-3-CF ₃	3-Cl	
3-104	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Br	F-3-CF ₃	
3-105	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Br	1,4-Br ₂	
3-106	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Br	1,6-Cl ₂	
3-107	CF ₃	H	H	O	N	2	SCH ₃	3-Cl	
3-108	CF ₃	H	H	O	CH	2	SCH ₃	3-Cl	
3-109	CF ₃	H	H	O	N	2	Cl-2-OMs	3-Cl	
3-110	CF ₃	H	H	O	CH	2	Cl-2-OMs	3-Cl	

* OMs:OSO₂CH₃

[0138]

30 【表307】

第3表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(R) ₄	D	Nの 結合	I ₁	I ₂	物理 性質 mp. °C
3-111	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-112	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-113	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-114	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-115	CF ₃	H	CH ₃	O	N	2	4-Cl	1-CN	
3-116	CF ₃	H	CH ₃	O	CH	2	4-Cl	1-CN	
3-117	CF ₃	H	OH	O	N	2	4-Cl	7-OH	
3-118	CF ₃	H	OH	O	CH	2	4-Br	7-OH	
3-119	CH ₃	H	H	O	R	2	2-Cl	3-C ₆ H ₅	
3-120	CH ₃	H	H	O	CH	2	2-Cl	3-C ₆ H ₅	
3-121	CF ₃ H	H	H	O	N	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-122	CF ₃ H	H	H	O	CH	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-123	CF ₃ Cl	H	H	O	N	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-124	CF ₃ Cl	H	H	O	CH	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-125	CF ₃ Cl	H	H	O	N	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-126	CF ₃ Cl	H	H	O	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-127	CF ₃ Cl	H	H	O	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-128	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-129	CF ₃	H	H	O	N	2	4-Cl	7-COCH ₃	
3-130	CF ₃	H	H	O	CH	2	4-Cl	7-COCH ₃	

[0139]

[表308]

第3表(続き)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(R) ₂ ・	R	Nの結合	X _n	Y _n	物性値 mp. °C
3-131	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-132	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-133	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-134	CF ₃	H	H	結合	CH	1	4-CF ₃	-	[190-191]
3-135	CF ₃	H	H	結合	N	1	4-CF ₃	-	
3-136	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	4-Cl	2-CN	
3-137	CF ₃	H	OH	結合	N	1	4-Cl	7-OH	
3-138	CF ₃	H	OH	結合	CH	1	4-F	7-OH	
3-139	CH ₃	H	H	結合	N	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-140	CH ₃	H	H	結合	CH	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-141	CF ₂ H	H	H	結合	N	1	4-Br	7-OCH ₃	
3-142	CF ₂ H	H	H	結合	CH	1	4-Br	7-OCH ₃	
3-143	CF ₂ Cl	H	H	結合	N	1	4-Cl	7-CF ₃	
3-144	CF ₂ Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-145	CF ₂ Cl	H	H	結合	N	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-146	CF ₂ Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-147	CF ₂ Cl	H	H	結合	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-148	CF ₃	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-149	CF ₃	H	H	結合	N	2	4-Cl	7-COCH ₃	
3-150	CF ₃	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-COCH ₃	

[0140]

[表309]

第3表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの結合	X -	Y _n	物理性 mp. °C
3-151	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-152	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-153	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-154	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-155	CF ₃	H	CH ₃	結合	N	2	4-Cl	1-CH	
3-156	CF ₃	H	CH ₃	結合	CH	2	4-Cl	1-CH	
3-157	CF ₃	H	OH	結合	N	2	4-Cl	7-OH	
3-158	CF ₃	H	OH	結合	CH	2	4-F	7-OH	
3-159	CH ₃	H	H	結合	N	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-160	CH ₃	H	H	結合	CH	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-161	CF ₃ H	H	H	結合	N	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-162	CF ₃ H	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-163	CF ₃ Cl	H	H	結合	N	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-164	CF ₃ Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-165	CF ₃ Cl	H	H	結合	N	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-166	CF ₃ Cl	H	H	結合	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-167	CF ₃ Cl	H	H	結合	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-168	CF ₃	H	H	結合	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-169	CF ₃	H	H	結合	N	1	4-Cl	7-COOH	
3-170	CF ₃	H	H	結合	CH	1	4-Cl	7-COOH	

[0141]

[表310]

第3表(続)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(B) >	D	Nの 結合	X =	Y =	物性値 mp. °C
3-171	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	N	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-172	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-173	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	N	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-174	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-175	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	N	1	4-Cl	2-CH	
3-176	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	1	4-Cl	2-CH	
3-177	CF ₃	H	OH	CH ₃	N	1	4-Cl	7-OH	
3-178	CF ₃	H	OH	CH ₃	CH	1	4-Br	7-OH	
3-179	CH ₃	H	H	CH ₃	N	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-180	CH ₃	H	H	CH ₃	CH	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-181	CF ₃ H	H	H	CH ₃	N	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-182	CF ₃ H	H	H	CH ₃	CH	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-183	CF ₃ Cl	H	H	CH ₃	N	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-184	CF ₃ Cl	H	H	CH ₃	CH	2	4-Cl	7-CF ₃	
3-185	CF ₃ Cl	H	H	CH ₃	N	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-186	CF ₃ Cl	H	H	CH ₃	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-187	CF ₃ Cl	H	H	CH ₃	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-188	CF ₃	H	H	CH ₃	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-189	CF ₃	H	H	CH ₃	N	2	4-Cl	7-COCH ₃	
3-190	CF ₃	H	H	CH ₃	CH	2	4-Cl	7-COCH ₃	

[0142]

[表311]

第3表(続き)

化合物番号	R'	R''	R''	(R') ₂	D	Nの結合	X	Y	物性値 mp. °C
3-191	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	N	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-192	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	1	4-Br ₂ CH ₃	3-Cl	
3-193	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	N	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-194	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-195	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	2	4-Cl	1-CH	
3-196	CP ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH	2	4-Cl	1-CH	
3-197	CP ₃	H	OH	CH ₃	N	1	4-Cl	7-OH	
3-198	CP ₃	H	OH	CH ₃	CH	1	4-F	7-OH	
3-199	CH ₃	H	H	CH ₃	N	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-200	CH ₃	H	H	CH ₃	CH	1	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-201	CP ₂ H	H	H	CH ₃	N	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-202	CP ₂ H	H	H	CH ₃	CH	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-203	CP ₂ Cl	H	H	CH ₃	N	1	4-Cl	7-CP ₃	
3-204	CP ₂ Cl	H	H	CH ₃	CH	1	4-Cl	7-CP ₃	
3-205	CP ₂ Cl	H	H	CH ₃	N	1	4-Br	6-SCH ₃	
3-206	CP ₂ Cl	H	H	CH ₃	CH	1	4-Cl	6-SCH ₃	
3-207	CP ₂ Cl	H	H	CH ₃	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-208	CP ₃	H	H	CH ₃	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-209	CP ₃	H	H	CH ₃	N	1	4-Cl	7-COCH ₃	
3-210	CP ₃	H	H	CH ₃	CH	1	4-Cl	7-COCH ₃	

[0143]

[表312]

第3表(続き)

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの 結合	X ₁	Y ₁	物性値 mp. °C
3-211	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-212	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-213	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-214	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	1	4-Br-Ph	3-Cl	
3-215	CF ₃	H	CH ₃	CO	H	2	4-Cl	1-CN	
3-216	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	4-Cl	1-CN	
3-217	CF ₃	H	OH	CO	H	1	4-Cl	7-OH	
3-218	CF ₃	H	OH	CO	CH	1	4-F	7-OH	
3-219	CH ₃	H	H	CO	H	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-220	CH ₃	H	H	CO	CH	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-221	CF ₃ H	H	H	CO	H	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-222	CF ₃ H	H	H	CO	CH	2	4-Br	7-OCH ₃	
3-223	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	4-Cl	7-CP ₃	
3-224	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	7-CP ₃	
3-225	CF ₃ Cl	H	H	CO	H	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-226	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-227	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-228	CF ₃	H	H	CO	CH	2	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-229	CF ₃	H	H	CO	H	1	4-Cl	7-COCH ₃	
3-230	CF ₃	H	H	CO	CH	1	4-Cl	7-COCH ₃	

[0144]

[表313]

第3表(続吉)

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	(E)	D	Nの結合	X _n	Y _n	物性値 mp. °C
3-231	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-232	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	1	4-SO ₂ CH ₃	3-Cl	
3-233	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-234	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	4-Br-Ph	3-Cl	
3-235	CF ₃	H	CH ₃	CO	N	2	4-Cl	1-CN	
3-236	CF ₃	H	CH ₃	CO	CH	2	4-Cl	1-CN	
3-237	CF ₃	H	OH	CO	N	1	4-Cl	7-OH	
3-238	CF ₃	H	OH	CO	CH	1	4-Cl	7-OH	
3-239	CH ₃	H	H	CO	R	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-240	CH ₃	H	H	CO	CH	2	2-Cl	3-C ₂ H ₅	
3-241	CF ₃ H	H	H	CO	R	1	4-Br	7-OCH ₃	
3-242	CF ₃ H	H	H	CO	CH	1	4-Br	7-OCH ₃	
3-243	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	4-Cl	7-Cl	
3-244	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	7-Cl	
3-245	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	2	4-Br	6-SCH ₃	
3-246	CF ₃ Cl	H	H	CO	CH	2	4-Cl	6-SCH ₃	
3-247	CF ₃ Cl	H	H	CO	N	1	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-248	CF ₃	H	H	CO	CH	1	4-Br	7-SO ₂ CH ₃	
3-249	CF ₃	H	H	CO	N	1	4-Cl	7-COCH ₃	
3-250	CF ₃	H	H	CO	CH	1	4-Cl	7-COCH ₃	

[0145]

* * [表401]

第4表

化合物番号	¹ H-NMRデータ(CDCl ₃ , TMS, δ ppm)
1-42	3.50(3H, s), 6.96(1H, m), 7.07(2H, d), 7.11(1H, s), 7.22(2H, d), 7.37(2H, d), 8.40(1H, s)
1-82	3.50(3H, s), 6.95(1H, d), 7.28-7.35(2H, m), 7.40-7.69(3H, m), 7.90(1H, s), 8.00(2H, m), 8.50(1H, s)
1-83	3.50(3H, s), 6.95(1H, d), 7.28-7.35(2H, m), 7.45(2H, d), 7.85(1H, s), 7.95(2H, d), 8.50(1H, s)

[0146] (農園芸用殺虫剤) 次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。以下の製剤実施例中の部は亘部を表す。

【0147】

実施例5 水和剤

本発明化合物	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉碎することにより、有効 * [0148]
成分40%の水和剤を得る。
*

実施例6 乳剤

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル	7部

以上を混合溶解することにより、有効成分30%の乳剤 * [0149]
を得る。
*

実施例7 粉剤

本発明化合物	10部
タルク	89部
ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル	1部

以上を均一に混合して微細に粉碎することにより、有効 * [0150]
成分10%の粉剤を得る。
★

実施例8 錠剤

本発明化合物	5部
クレー	73部
ペントナイト	20部
ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩	1部
リン酸ナトリウム	1部

以上を粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒 ★ [0151]
乾燥して有効成分5%の錠剤を得る。
★

実施例9 壁濁剤

本発明化合物	10部
リグニンスルホン酸ナトリウム	4部
ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム	1部
キサンタンガム	0.2部
水	84.8部

以上を混合し、粒度が1ミクロン以下になるまで湿式粉
碎することにより、有効成分10%の壁濁剤を得る。

[0152]

【発明の効果】 (試験例-殺虫・殺ダニ剤)

試験例1 アワヨトウに対する効力試験

前記の薬剤の実施例5に示された水和剤の处方に従い、
化合物濃度が12.5 ppmになるように水で希釈した。その葉液中にトウモロコシ葉を30秒間浸漬し、顯微
鏡下、アワヨトウ2令幼虫が5頭入っているシャーレにそ
の葉を入れた。ガラス蓋をして、温度25°C、湿度65%の恒温室内に置き、5日後に殺虫率を調べた。試験は
2回で行った。対照化合物として、クロルジメホルム
(12.5 ppm)を用いた。その結果、以下の化合物が

80%以上の優れた殺虫率を示した。一方、対照化合物◆

[0153] 化合物番号: 1-1, 1-2, 1-3, 1-
4, 1-10, 1-12, 1-13, 1-14, 1-
15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-
20, 1-21, 1-23, 1-24, 1-26, 1-
27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-
33, 1-34, 1-37, 1-38, 1-39, 1-
40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-
45, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-
52, 1-53, 1-54, 1-56, 1-58, 1-
59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-
65, 1-66, 1-67, 2-1, 2-2, 2-3,
2-4, 2-5, 2-6

フロントページの続き

(51)Int.CI.:

A 01 N 43/40
43/54

識別記号

101

F I

A 01 N 43/40
43/54

コード(参考)

101 D
B

C 07 D 239/28
239/34

(72)発明者 岩佐 幸男
神奈川県小田原市高田345 日本曹連株式
会社小田原研究所内
(72)発明者 武 智広
神奈川県小田原市高田345 日本曹連株式
会社小田原研究所内
(72)発明者 高橋 美光
神奈川県小田原市高田345 日本曹連株式
会社小田原研究所内

C 07 D 239/28
239/34

F ターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA06 BA08 BA13
BA18 BA21 BA42 BB02 BB04
BB07 BB08 BB09 BB11 CA02
CA18 DA01 DA06 DA13 DA39
DA42 DA51 DA59 DE02 DE04
DE07
4H011 AC02 AC04 BB09 DA02 DA13
DA15 DA16